

特 許 協 力 条 約

発信人 日本国特許庁（国際予備審査機関）

出願人代理人 大野 彰夫 殿 あて名 〒 140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内		PCT 国際予備審査報告の送付の通知書 （法施行規則第57条） [PCT規則71.1]	
		発送日 （日.月.年） 20.1.2004	
出願人又は代理人 の書類記号 FP0309		重要な通知	
国際出願番号 PCT/JPO3/09108	国際出願日 （日.月.年） 17.07.2003	優先日 （日.月.年） 18.07.2002	
出願人（氏名又は名称） 三共株式会社			
1. 国際予備審査機関は、この国際出願に関して国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、それらをこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。 2. 国際予備審査報告及び付属書類が作成されている場合には、すべての選択官庁に通知するために、それらの写しを国際事務局に送付する。 3. 選択官庁から要求があったときは、国際事務局は国際予備審査報告（付属書類を除く）の英語の翻訳文を作成し、それをその選択官庁に送付する。 4. 注 意 出願人は、各選択官庁に対し優先日から30月以内に（官庁によってはもっと遅く）所定の手続（翻訳文の提出及び国内手数料の支払い）をしなければならない（PCT39条（1））（様式PCT/IB/301とともに国際事務局から送付された注を参照）。 国際出願の翻訳文が選択官庁に提出された場合には、その翻訳文は、国際予備審査報告の付属書類の翻訳文を含まなければならない。 この翻訳文を作成し、関係する選択官庁に直接送付するのは出願人の責任である。 選択官庁が適用する期間及び要件の詳細については、PCT出願人の手引き第II巻を参照すること。			

名称及びあて名 日本国特許庁（IPEA/JP） 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	権限のある職員 特 許 庁 長 官 電話番号 03-3581-1101 内線 3452	4C	3039
---	---	----	------

注 意

1. 文献の写しの請求について

国際予備審査報告に記載された文献であつて国際調査報告に記載されていない文献の複写

特許庁にこれらの引用文献の写しを請求することもできますが、独立行政法人工業所有権総合情報館（特許庁庁舎2階）で公報類の閲覧・複写および公報以外の文献複写等の取り扱いをしています。

〔担当及び照会先〕

〒100-0013 東京都千代田区霞が関3丁目4番3号（特許庁庁舎2階）

独立行政法人工業所有権総合情報館

【公報類】 閲覧部 TEL 03-3581-1101 内線3811～2

【公報以外】 資料部 TEL 03-3581-1101 内線3831～3

また、（財）日本特許情報機構でも取り扱いをしています。

これらの引用文献の複写を請求する場合は下記の点に注意してください。

〔申込方法〕

（1）特許（実用新案・意匠）公報については、下記の点を明記してください。

○特許・実用新案及び意匠の種類

○出願公告又は出願公開の年次及び番号（又は特許番号、登録番号）

○必要部数

（2）公報以外の文献の場合は、下記の点に注意してください。

○国際予備審査報告の写しを添付してください（返却します）。

〔申込み及び照会先〕

〒135-0016 東京都江東区東陽4-1-7 佐藤ビル

財団法人 日本特許情報機構 情報処理部業務課

TEL 03-3508-2313

注） 特許庁に対して文献の写しの請求をすることができる期間は、国際出願日から7年です。

2. 各選択官庁に対し、国際出願の写し（既に国際事務局から送達されている場合は除く）及びその所定の翻訳文を提出し、国内手数料を支払うことが必要となります。その期限については各国ごとに異なりますので注意してください。（条約第22条、第39条及び第64条(2)(a)(i)参照）

特 許 協 力 条 約

P C T

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 F P 0 3 0 9	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ I P E A / 4 1 6)を参照すること。	
国際出願番号 P C T / J P 0 3 / 0 9 1 0 8	国際出願日 (日.月.年) 1 7 . 0 7 . 2 0 0 3	優先日 (日.月.年) 1 8 . 0 7 . 2 0 0 2
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. A61K45/06, 31/145, 31/167, 31/17, 31/255, 31/404, 31/405, 31/4365, 31/4439, 31/661, 31/663, A61P9/00, 9/10		
出願人(氏名又は名称) 三共株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条(PCT36条)の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input checked="" type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input checked="" type="checkbox"/> 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 1 7 . 0 7 . 2 0 0 3	国際予備審査報告を作成した日 0 5 . 0 1 . 2 0 0 4	
名称及びあて先 日本国特許庁 (I P E A / J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官(権限のある職員) 富永 保 印	4 C 3 0 3 9
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

Ⅲ. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 14, 15

理由：

☒ この国際出願又は請求の範囲 14, 15 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 14, 15 は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT 第 34 条(4)(a)(i) 及び PCT 規則 67.1(iv) の規定により、この国際予備審査機関が国際予備審査を行うことを要しない対象に係るものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 14, 15 について、国際調査報告が作成されていない。

2. スクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書 C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-13	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-13	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-13	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

- 文献1 : EP 866059 A1 (Kyoto Pharmaceutical Industries, Ltd.) 1998.09.23
文献2 : WO 02/04461 A1 (三共株式会社) 2002.01.17
文献3 : WO 94/18216 A1 (FISONS PLC) 1994.08.18
文献4 : WO 01/96311 A2 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 2001.12.20
文献5 : JP 62-167791 A (森永乳業株式会社) 1987.07.24
文献6 : CHILMONCZYK, Z. et al, Hypolipidaemic and antiplatelet agents, Expert Opinion on Therapeutic Patents, 2001, Vol.11, No.8, p.1301-1327. (abstract) EMBASE [online]
EMBASE Accession no. 2001272597

国際調査報告で引用された上記文献1には、ACAT阻害作用を有する化合物が動脈硬化症等の予防及び治療に有用であることが記載されており (Abstract参照)、また、ACAT阻害剤として、N-(1-オクチル-5-カルボキシメチル-4, 6-ジメチルインドリン-7-イル)-2, 2-ジメチルプロパンアミド又はその塩が最も好ましい化合物として例示されている (第6頁第34-38行参照)。

同文献2には、2-アセトキシ-5-(α -シクロプロピルカルボニル-2-フルオロベンジル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロチエノ [3, 2-c] ピリジンの酸付加塩が血小板凝集抑制作用を有し、血栓症や塞栓症の治療又は予防薬として有用であることが記載されている (第1頁下6行-第2頁第9行参照)。

同文献3には、N-[2-(メチルチオ)エチル]-2-[(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)チオ]-5'-アデニル酸とジクロロメチレンビスフォスホン酸との無水物等のATP類似体が血小板凝集防止活性を有しており、血栓塞栓症等の治療や予防に適応することが記載されている (Claim6, 第7頁第4-13行参照)。

同文献4には、HMG CoAレダクターゼインヒビターとともに、脂質調整剤と血小板凝集阻害剤を併用し得ることが記載されており (Claim9-11参照)、脂質調整剤として、ACATインヒビターを用い得ること、血小板凝集阻害剤としてclopidogrelやticlopidineを選択し得ること、及び、上記薬剤の組合せを、アテローム性動脈硬化症や、末梢動脈疾患の治療や予防に適用し得ることが記載されている (claim11, 15等参照)。

Ⅷ. 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求項 1-13

請求の範囲 1-13 は、「ADP 受容体拮抗剤」及び／又は「ACAT 阻害剤」という所望の性質により定義された化合物を有効成分とする動脈硬化症の予防又は治療剤に関するものである。本願上記請求の範囲には、そのような特性を有するあらゆる化合物が包含されるが、PCT 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT 5 条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎないものと認められる。

また、「ADP 受容体拮抗剤」及び「ACAT 阻害剤」は、出願時の技術常識を勘案してもそのような性質を有する化合物の範囲を特定できないから、請求の範囲 1-13 は、PCT 6 条における明確性の要件も欠いている。

補充欄（いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること）

第 V 欄の続き

同文献5には、血小板凝集抑制剤を血小板の凝集に起因する疾患の治療、予防に使用することが記載されている（第1頁左欄第8-15行参照）。また、血栓症によって動脈硬化が促進することが記載されている（第2頁左上欄第10-12行参照）。

同文献6には、アテローム性動脈硬化症等の心血管関連疾患の治療に、ACAT阻害剤等の抗高脂血症剤、及び、血小板凝集抑制剤が用いられることが記載されている。

<新規性について>

請求の範囲1-13

請求の範囲1-13に記載された発明は、上記文献1-6に記載されておらず、新規性を有する。

<進歩性について>

請求の範囲1-13

(1) 文献1-5

文献2-4に記載されているように、本願請求の範囲2-8に記載されているようなADP受容体拮抗作用を有する化合物が血小板凝集抑制作用を有することは公知であり、また、文献5に記載されているように、動脈硬化が血小板の凝集により促進されることも公知である。

そして、ACAT阻害剤を動脈硬化の治療等に使用し得ること（文献1参照）、及び、ACAT阻害剤と血小板凝集阻害剤を、アテローム性動脈硬化症等の治療のために併用し得ることは公知の事項であり（文献4参照）、さらに、医療の分野において、特定疾患に対する有効成分を併用することにより、その薬効を増強しようとすることは、通常行われることでもあるので、動脈硬化への薬効の増強を期待して、ACATインヒビターと、本願請求の範囲2-8に記載されているようなADP受容体拮抗作用を有する化合物とを併用することは、当業者が容易になし得た事項と認められる。

そして、その効果が格別であるとも認められない。

したがって、請求の範囲1-13に記載された発明は、上記文献1-5に対して進歩性を有さない。

(2) 文献1-4, 6

文献6には、アテローム性動脈硬化症等の心血管関連疾患の治療に、ACAT阻害剤等の抗高脂血症剤、及び、血小板凝集抑制剤が用いられることが記載されており、文献6のこの記載に基づき、動脈硬化症に対して、ACAT阻害剤と血小板凝集抑制剤を併用することは当業者が容易になし得た事項と認められる。また、ACAT阻害剤として文献1に記載の化合物、血小板凝集抑制剤として文献2-4に記載の化合物を用いることも、当業者が適宜なし得ることである。

そして、その効果が格別であるとも認められない。

したがって、請求の範囲1-13に記載された発明は、上記文献1-4, 6に対して進歩性を有さない。